

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
29 avril 2004 (29.04.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2004/035552 A1

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 257/04, C07C  
317/28, A61K 31/167, 31/41, A61P 9/10

Péri-Albo, Viviers-les-Montagnes, F-81290 Labruguière (FR). DELHON, André [FR/FR]; 36, rue Hector-Berlioz, F-81100 Castres (FR). JUNQUERO, Didier [FR/FR]; 4, rue des Sources, F-81300 Burlats (FR).

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2003/003038

(74) Mandataires : MARTIN, Jean-Jacques etc.; Cabinet Regimbeau, 20, rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17 (FR).

(22) Date de dépôt international :  
15 octobre 2003 (15.10.2003)

(81) États désignés (national) : AU, BR, CA, CN, JP, MX, US, ZA.

(25) Langue de dépôt : français

(84) États désignés (régional) : brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

(26) Langue de publication : français

(Publiée :  
— avec rapport de recherche internationale  
— avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont requises

(30) Données relatives à la priorité :  
02/12855 16 octobre 2002 (16.10.2002) FR

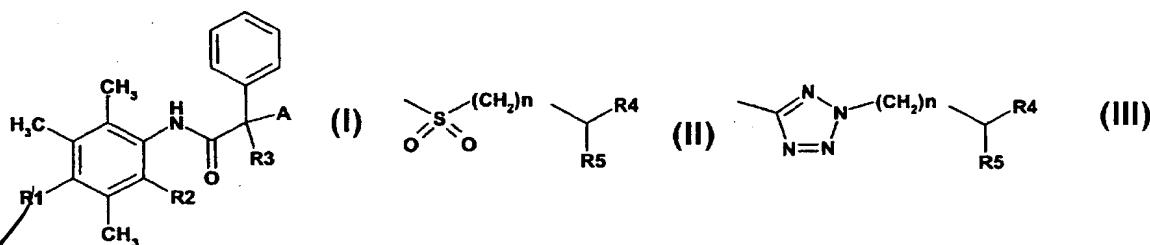
*En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.*

(71) Déposant : PIERRE FABRE MEDICAMENT [FR/FR]; 45, place Abel-Gance, F-92100 Boulogne-Billancourt (FR).

(72) Inventeurs; et  
(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : PA-  
TOISEAU, Jean-François [FR/FR]; 7, rue Jules-Ferry,  
F-81100 Castres (FR). AUTIN, Jean-Marie [FR/FR];

(54) Title: ALPHA-PHENYL ACETANILIDE DERIVATIVES HAVING AN ACAT INHIBITING ACTIVITY AND THE THERAPEUTIC APPLICATION THEREOF

(54) Titre : DERIVES D'ALPHA-PHENIL ACETANILIDES PRESENTANT UNE ACTIVITE INHIBITRICE DE L'ACAT ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(57) Abstract: The invention relates to novel derivatives having general formula (I), wherein R<sub>1</sub> represents an amino or hydroxyl group, R<sub>2</sub> represents hydrogen or a methyl radical, R<sub>3</sub> represents hydrogen or a fluorine atom and A represents: group a, formula (II), wherein n represents an integer from 5 to 11, inclusive, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, which can be identical or different, represent independently of one another hydrogen or a fluorine atom; group b, formula (III), wherein n, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> have the same meaning as above. The invention also relates to the pharmaceutical compositions containing at least one of the aforementioned compounds by way of an active principle and to the use of said derivatives for the production of medicaments which are intended for the treatment of hypercholesterolemia or atherosclerosis.

(57) Abrégé : L'invention concerne de nouveaux dérivés de formule générale (I) dans laquelle: -R<sub>1</sub> représente un groupement hydroxyle ou amino -R<sub>2</sub> représente l'hydrogène ou un radical méthyle -R<sub>3</sub> représente l'hydrogène ou un atome de fluor -A représente un groupement (II) dans lequel: -n représente un nombre entier de 5 à 11 bornes incluses -R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> identiques ou différents représentent indépendamment l'un ou l'autre l'hydrogène ou un atome de fluor (III) dans lequel n, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> ont la même signification que précédemment. Elle concerne également les compositions pharmaceutiques comprenant à titre de principe actif au moins un de ces composés, ainsi que l'utilisation de ces dérivés pour la fabrication de médicaments destinés au traitement de l'hypercholestérolémie ou de l'athérosclérose.

WO 2004/035552 A1